

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/JP2004/014063

PCTNOTIFICATION CONCERNING
TRANSMITTAL OF COPY OF INTERNATIONAL
PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY
(CHAPTER I OF THE PATENT COOPERATION
TREATY)

(PCT Rule 44bis, 1(c))

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

EISAI CO., LTD.
6-10, Koishikawa 4-chome, Bunkyo-ku
Tokyo 1128022
JAPON

06.4.17

領

Date of mailing (day/month/year)

13 April 2006 (13.04.2006)

Applicant's or agent's file reference

EPC04-EE01

IMPORTANT NOTICE

International application No.

PCT/JP2004/014063

International filing date (day/month/year)

27 September 2004 (27.09.2004)

Priority date (day/month/year)

30 September 2003 (30.09.2003)

Applicant

0441W01

19283w

EISAI CO., LTD. et al

The International Bureau transmits herewith a copy of the international preliminary report on patentability (Chapter I of the Patent Cooperation Treaty).

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Masashi Honda

Facsimile No. +41 22 740 14 35

Facsimile No. +41 22 338 70 10

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY (Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bis)

Applicant's or agent's file reference EPC04-EE01	FOR FURTHER ACTION	See item 4 below
International application No. PCT/JP2004/014063	International filing date (<i>day/month/year</i>) 27 September 2004 (27.09.2004)	Priority date (<i>day/month/year</i>) 30 September 2003 (30.09.2003)
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237		
Applicant EISAI CO., LTD.		

1.	This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 <i>bis</i> .1(a).																								
2.	This REPORT consists of a total of 9 sheets, including this cover sheet. In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.																								
3.	<p>This report contains indications relating to the following items:</p> <table style="width: 100%;"> <tr> <td style="width: 10%; text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td style="width: 30%;">Box No. I</td> <td style="width: 60%;">Basis of the report</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. II</td> <td>Priority</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. III</td> <td>Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. IV</td> <td>Lack of unity of invention</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. V</td> <td>Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. VI</td> <td>Certain documents cited</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input type="checkbox"/></td> <td>Box No. VII</td> <td>Certain defects in the international application</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;"><input checked="" type="checkbox"/></td> <td>Box No. VIII</td> <td>Certain observations on the international application</td> </tr> </table>	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. I	Basis of the report	<input type="checkbox"/>	Box No. II	Priority	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. IV	Lack of unity of invention	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement	<input type="checkbox"/>	Box No. VI	Certain documents cited	<input type="checkbox"/>	Box No. VII	Certain defects in the international application	<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. VIII	Certain observations on the international application
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. I	Basis of the report																							
<input type="checkbox"/>	Box No. II	Priority																							
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability																							
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. IV	Lack of unity of invention																							
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement																							
<input type="checkbox"/>	Box No. VI	Certain documents cited																							
<input type="checkbox"/>	Box No. VII	Certain defects in the international application																							
<input checked="" type="checkbox"/>	Box No. VIII	Certain observations on the international application																							
4.	The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis .2).																								

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Date of issuance of this report 03 April 2006 (03.04.2006) Authorized officer <div style="text-align: center; font-weight: bold; font-size: 1.2em;">Masashi Honda</div>
Facsimile No. +41 22 740 14 35	Telephone No. +41 22 338 70 10

特許協力条約

発信人 日本国特許庁 (国際調査機関)

出願人代理人

エーザイ株式会社

様

あて名

〒 112-8088

東京都文京区小石川4丁目6番10号

REC'D 04 JAN 2005

WIPO

PCT

PCT

国際調査機関の見解書
(法施行規則第40条の2)
[PCT規則43の2.1]

発送日
(日.月.年)

28.12.2004

出願人又は代理人
の書類記号

EPC04-EE01

今後の手続きについては、下記2を参照すること。

国際出願番号

PCT/JP2004/014063

国際出願日

(日.月.年) 27.09.2004

優先日

(日.月.年) 30.09.2003

国際特許分類 (IPC) Int. Cl' C07D209/08, 263/56, 405/12, 409/12, 239/48, 239/72, 241/44, 239/94, 495/04, 215/48, 215/38, 215/20, 215/12, 277/62, 217/02, 241/20, 239/42, 491, /048, 471/04, 213/82, 213/83, 401/12, 417/12, 409/14, 417/14, 401/14,

出願人 (氏名又は名称)

エーザイ株式会社

1. この見解書は次の内容を含む。

- ☒ 第I欄 見解の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成
- ☒ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT規則43の2.1(a)(i)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☐ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☒ 第VIII欄 国際出願に対する意見

2. 今後の手続き

国際予備審査の請求がされた場合は、出願人がこの国際調査機関とは異なる国際予備審査機関を選択し、かつ、その国際予備審査機関がPCT規則66.1の2(b)の規定に基づいて国際調査機関の見解書に国際予備審査機関の見解書とみなさない旨を国際事務局に通知していた場合を除いて、この見解書は国際予備審査機関の最初の見解書とみなされる。

この見解書が上記のように国際予備審査機関の見解書とみなされる場合、様式PCT/ISA/220を送付した日から3月又は優先日から22月のうちいずれか遅く満了する期限が経過するまでに、出願人は国際予備審査機関に、適当な場合は補正書とともに、答弁書を提出することができる。

さらなる選択肢は、様式PCT/ISA/220を参照すること。

3. さらなる詳細は、様式PCT/ISA/220の備考を参照すること。

見解書を作成した日

07.12.2004

名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

中木 亜希

4P

9282

電話番号 03-3581-1101 内線 3492

様式PCT/ISA/237 (表紙) (2004年1月)

第 I 欄 見解の基礎

1. この見解書は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎として作成された。

- ☐ この見解書は、_____ 語による翻訳文を基礎として作成した。
それは国際調査のために提出された PCT 規則 12.3 及び 23.1(b) にいう翻訳文の言語である。

2. この国際出願で開示されかつ請求の範囲に係る発明に不可欠なヌクレオチド又はアミノ酸配列に関して、以下に基づき見解書を作成した。

a. タイプ ☒ 配列表

☐ 配列表に関連するテーブル

b. フォーマット ☐ 書面

☒ コンピュータ読み取り可能な形式

c. 提出時期 ☒ 出願時の国際出願に含まれる

☐ この国際出願と共にコンピュータ読み取り可能な形式により提出された

☐ 出願後に、調査のために、この国際調査機関に提出された

3. ☐ さらに、配列表又は配列表に関連するテーブルを提出した場合に、出願後に提出した配列若しくは追加して提出した配列が出願時に提出した配列と同一である旨、又は、出願時の開示を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった。

4. 補足意見：

第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 38, 40

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 38, 40 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 38 及び 40 に記載された発明は、治療による人体の処置方法に関するものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 38, 40 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

- ☐ 提出されていない。
- ☐ 所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

- ☐ 提出されていない。
- ☐ 所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

- ☐ 提出されていない。
- ☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

第IV欄 発明の単一性の欠如

1. 追加手数料納付の求め(様式PCT/ISA/206)に対して、出願人は、

- ☐ 追加手数料を納付した。
☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
☐ 追加手数料の納付はなかった。

2. ☒ 国際調査機関は、発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際調査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
☒ 以下の理由により満足しない。

式(I)、式(I-a)及び式(I-b)の化合物は本願出願前にすでに公知であり(この国際調査報告における「C. 関連すると認められる文献」の欄を参照。)、また、式(I)の化合物を抗真菌剤に適用することも本願出願前にすでに公知である(JP 2000-504336 A、等を参照。)。してみると、本願は、下記i~iiiの発明群が存在する。

発明群 i : 請求の範囲1-2
(発明の特別な技術的特徴は、式(I)の化合物を抗真菌剤に適用することにある。)

発明群 ii : 請求の範囲3-33、並びに、請求の範囲3を引用する請求の範囲36、37及び39
(発明の特別な技術的特徴は、式(I-a)の化合物にある。)

発明群 iii : 請求の範囲34、35、並びに、請求の範囲34を引用する請求の範囲36、37及び39
(発明の特別な技術的特徴は、式(I-b)の化合物にある。)

さらに、請求の範囲1にマーカッシュ形式で記載された各種の抗真菌剤は、上記で述べたとおり、本願出願前に公知であることから、請求の範囲1に記載された各種抗真菌剤は、互いに、単一の一般的発明概念を形成するように連関している一群の発明であるとは認められない。

請求の範囲3及び請求の範囲34のそれぞれについても、上記と同様の理由により、単一の一般的発明概念を形成するように連関している一群の発明であるとは認められない。

4. したがって、国際出願の次の部分について、この見解書を作成した。

- ☐ すべての部分
☒ 請求の範囲 1-37, 39 に関する部分

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についてのPCT規則43の2.1(a)(i)に定める見解、
それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	7-15, 23-33	有
	請求の範囲	1-6, 16-22, 34-37, 39	無
進歩性 (IS)	請求の範囲	7-15, 23-33	有
	請求の範囲	1-6, 16-22, 34-37, 39	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-37, 39	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明

1. JP 2000-504336 A
2. WO 02/022583 A2
3. JP 2003-506466 A
4. JP 7-25853 A
5. JP 61-148178 A
6. JP 3-161470 A
7. WO 02/083645 A1
8. WO 03/045385 A1
9. JP 59-206353 A
10. Synthesis, 1998, No. 10, p. 1467-1475
11. JP 1-246264 A
12. JP 54-2325 A
13. JP 10-505600 A
14. JP 3-66689 A

A. 請求の範囲 1, 2

請求の範囲 1 及び 2 に記載された発明は、文献 1 より新規性及び進歩性を有しない。

文献 1 には、式 (I) で表される化合物を抗真菌剤に適用することが記載されており、また、式 (I) の具体例である実施例 60 の化合物は、本願の式 (I) の化合物に相当する。

B. 請求の範囲 3-33, 36, 37, 39

a. 請求の範囲 3-6, 16-22, 36, 37, 39

請求の範囲 3-6, 16-22, 36, 37 及び 39 に記載された発明は、文献 1-10 のいずれかにより、新規性及び進歩性を有しない。

第Ⅳ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲1に記載の式(I)の化合物、及び、請求の範囲3に記載の式(I-a)の化合物は、非常に多数の化合物を包含しており、また、実施例も多岐にわたって記載されている。

そのため、請求の範囲1及び請求の範囲3に記載された発明について、過度の負担無く、完全な調査を行うことができず、この見解書は、該調査に基づいて作成した。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

文献1-5、9及び10には、本願の式(I-a)で表される化合物のうち、A¹が3-ピリジル基である化合物が記載されている。(例えば、文献1の実施例60、文献2の化合物9、文献3の表A、文献4の表1、文献5の実施例12、文献9の例15、17、及び、文献10の化合物2eを参照。)

文献6、7及び8には、本願の式(I-a)で表される化合物のうち、A¹がインドリル基、キノリル基及びベンゾチアゾリル基である化合物がそれぞれ記載されている。(例えば、文献6の実施例32、文献7の実施例5、51、53、57、59、62、及び、文献8の化合物70を参照。)

さらに、文献1、5-9には、上記化合物を医薬に適用することが記載されており、特に、文献1には、該医薬の適用疾患が真菌感染症であることも記載されている。

b. 請求の範囲7-15, 23-33

請求の範囲7-15、23-33に記載された発明は、文献1-10に対して新規性及び進歩性を有する。

請求の範囲7-15、23-33に記載された化合物は、文献1-10のいずれにも記載されておらず、また、該化合物に想到することが当業者にとって自明であったとも認められない。

C. 請求の範囲34, 35

請求の範囲34及び35に記載された発明は、文献11-14のいずれかにより新規性及び進歩性を有しない。

文献11-13には、本願の式(I-b)で表される化合物のうち、A²が4-キナゾリル基である化合物が記載されており、文献14には、本願の式(I-b)で表される化合物のうち、A²がピリド[2, 3-d]ピリミジン-4-イル基である化合物が記載されている。(例えば、文献11の実施例24、60、68、文献12の化合物2、5、8、文献13の実施例18、及び、文献14の実施例59等を参照。)

さらに、文献11及び12に記載の上記化合物は、本願の式(I-b)において、X²が-NH-CH₂-で表される基である化合物に相当する。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

国際特許分類 (IPC) の続き

Int. Cl.⁷ A61K31/404, 31/423, 31/443,
31/517, 31/498, 31/4365, 31/47, 31/472,
31/4965, 31/505, 31/428, 31/433, 31/4355,
31/435, 31/455, 31/44, 31/4436, 31/4439,
31/497, 31/506, 31/4709, A61P31/10